



⑬ BUNDESREPUBLIK
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES
PATENTAMT

⑫ **Offenlegungsschrift**
⑩ **DE 39 38 140 A 1**

⑤ Int. Cl. 5:
A 61 K 7/32
A 61 K 7/50
A 61 K 9/12
A 61 K 9/14
A 61 K 9/02
A 61 K 7/40
A 61 K 37/02

DE 39 38 140 A 1

29.

⑦ Anmelder:
Beiersdorf AG, 2000 Hamburg, DE

⑦ Erfinder:
Schmucker, Robert, Dr., 2000 Hamburg, DE;
Sauermann, Gerhard, Dr., 2351 Wiemersdorf, DE;
Eigener, Ulrich, Dr., 2000 Hamburg, DE; Engel,
Walter, 2080 Pinneberg, DE

⑤ Entgegenhaltungen:
DE 35 23 478 A1
DE 34 40 423 A1
DE 20 39 074 A1
EP 03 42 486 A1
EP 01 81 578 A2

DE-Z: SAHL, H.-G.: Kationische, Lanthionin- haltige
Peptidantibiotika. In: forum mikro- biologie 9/87,
S. 330-339;
- Chemical Abstracts, Vol. 108, 1988, Ref. 220540k; DE-
Z: SAHL, H.-G.: Kationische, Lanthionin-haltige
Peptidantibiotika. In: forum mikrobiologie 9/87,
S. 330-339;
- Chemical Abstracts, Vol. 108, 1988, Ref. 220540k;

Prüfungsantrag gem. § 44 PatG ist gestellt

⑤ Desodorierende kosmetische Mittel

⑤ Kosmetische Desodorantien, gekennzeichnet durch einen
wirksamen Gehalt an Lantibiotika, wobei die Lantibiotika
sowohl einzeln als auch im Gemisch vorliegen können.

DE 39 38 140 A 1

Best Available Copy

Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft kosmetische Desodorantien. Solche Formulierungen dienen dazu, Körpergeruch zu beseitigen, der entsteht, wenn der an sich geruchlose frische Schweiß durch Mikroorganismen zersetzt wird. Den handelsüblichen kosmetischen Desodorantien liegen unterschiedliche Wirkprinzipien zugrunde.

Durch Adstringentien — vorwiegend Aluminiumsalze wie Aluminiumhydroxychlorid — kann die Entstehung des Schweißes unterbunden werden. Abgesehen von der Denaturierung der Hautproteine greifen die dafür verwendeten Stoffe aber drastisch in den Wärmehaushalt der Achselregion ein und sollten allenfalls in Ausnahmefällen angewandt werden.

Durch antimikrobielle Stoffe kann die Bakterienflora auf der Haut reduziert werden. Dabei sollten im Idealfalle nur die Geruch verursachenden Mikroorganismen vernichtet werden. In der Praxis hat sich aber herausgestellt, daß die gesamte Mikroflora der Haut in gleichem Maße geschädigt werden. Gelegentlich werden sogar die Mikroorganismen, die keinen Geruch verursachen, stärker geschädigt.

Schließlich kann Körpergeruch auch durch Duftstoffe überdeckt werden, die klassische Methode, die aber am wenigsten den ästhetischen Bedürfnissen des Verbrauchers gerecht wird, da die Mischung aus Körpergeruch und Parfümduft eher unangenehm riecht.

Desodorantien sollen folgende Bedingungen erfüllen:

- 1) Die biologischen Vorgänge der Haut dürfen nicht beeinträchtigt werden.
- 2) Die Desodorantien sollen keinen ausgeprägten Eigengeruch besitzen.
- 3) Sie müssen bei Überdosierung oder sonstiger nicht bestimmungsgemäßer Anwendung unschädlich sein.
- 4) Sie sollen sich nach wiederholter Anwendung nicht auf der Haut anreichern.
- 5) Sie sollen sich gut in handelsübliche kosmetische Formulierungen einarbeiten lassen.

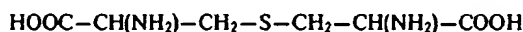
Bekannt und gebräuchlich sind sowohl flüssige Desodorantien, beispielsweise Aerosolsprays, Roll-ons und dergleichen als auch feste Zubereitungen, beispielsweise Deo-Stifte ("Sticks"), Puder, Pudersprays, Intimreinigungsmittel usw.

Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es, kosmetische Desodorantien zu entwickeln, die die Nachteile des Standes der Technik nicht aufweisen. Insbesondere sollten die Desodorantien die Mikroflora der Haut weitgehend schonen, die Mikroorganismen aber, die für den Körpergeruch verantwortlich sind, selektiv reduzieren.

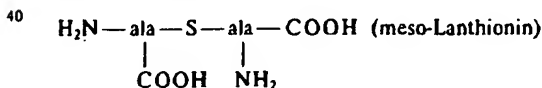
Es wurde gefunden, und darin liegt die Lösung der Aufgabe, daß kosmetische Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an Lantibiotika den Nachteilen des Standes der Technik abhelfen.

Lantibiotika sind seit vielen Jahren bekannt. Es sind Polypeptide, die von Mikroorganismen synthetisiert werden und sich durch das Vorhandensein von Lanthionin in der Peptidsequenz auszeichnen.

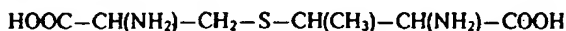
Die Lanthionine haben folgende Strukturen:



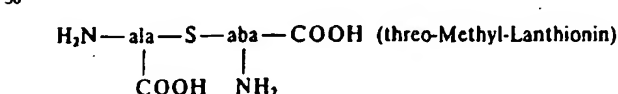
andere Schreibweise:



sowie



andere Schreibweise:



Mit diesen Lanthioninen werden in den Lantibiotika Ringstrukturen gebildet.

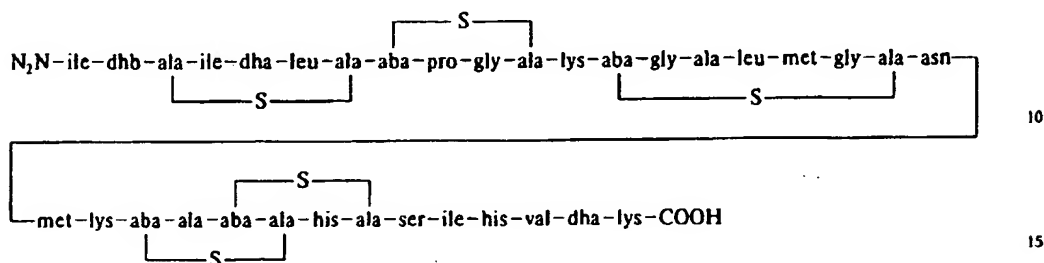
Beispiele für Lantibiotika sind Nisin, Epidermin, Subtilin, Cinramycin, Duramycin, Ancovenin, Gallidermin, Pep 5.

Die vorgenannten Stoffe sind an sich bekannt und können unter den Registraturnummern der Chemical Abstracts ermittelt werden:

Nisin:	1414-45-5
Epidermin:	99165-17-0
Subtilin:	1393-38-0
Pep 5:	110655-58-8
Duramycin:	1391-36-2
Ancovenin:	88201-41-6
Gallidermin:	117978-77-5

Nisin beispielsweise ist ein Peptid aus 34 Aminosäuren, welches von *Streptococcus lactis* synthetisiert wird. Es wirkt vorwiegend gegen Micrococccen und coryneforme Bakterien. In manchen Ländern ist es ein als Lebensmittelkonservierungsmittel zugelassenes Antibiotikum (nicht in den USA und der Bundesrepublik Deutschland).

Nisin besitzt folgende Aminosäuresequenz (Primärstruktur):



Lösung) den übrigen Bestandteilen der Formulierungen zugesetzt.

Die folgenden Beispiele dienen dazu, die Erfindung zu beschreiben, ohne daß beabsichtigt ist, die Erfindung auf diese Beispiele zu beschränken.

5

Beispiel 1

Pumpspray

10

Nisin (reine Substanz)	0,25 g
Ethanol pharm. (96%)	354,875 g
Parfüm, Farbstoff	nach Belieben
Wasser	auf 1 000 000 g

15

Beispiel 2

Pumpspray

20

Epidermin	0,010 g
Ethanol pharm. (96%)	354,875 g
Parfüm, Farbstoff	nach Belieben
Wasser	auf 1 000 000 g

25

Beispiel 3

Deo-Roller (Roll-on)

30

Nisin	0,150 g
Hydroxyethylcellulose	5,000 g
Propylenglycol	5,000 g
Ethanol pharm. (96%)	355,850 g
Parfüm, Farbstoff	nach Belieben
Wasser	auf 1 000 000 g

35

Beispiel 4

Deo-Roller (Roll-on)

40

Epidermin	0,120 g
Hydroxyethylcellulose	5,000 g
Propylenglycol	5,000 g
Ethanol pharm. (96%)	355,850 g
Parfüm, Farbstoff	nach Belieben
Wasser	auf 1 000 000 g

45

50

Beispiel 5

Spray

55

Nisin	0,200 g
Ethanol pharm. (96%)	150,000 g
Propylenglycol	50,000 g
Dimethylether	300,000 g
Parfüm	nach Belieben
Wasser	auf 1 000 000 g

60

65

Beispiel 6

Spray

Epidermin	0,150 g	5
Ethanol pharm. (96%)	150,000 g	
Propylenglycol	50,000 g	
Dimethylether	300,000 g	
Parfüm	nach Belieben	10
Wasser	auf 1 000 000 g	

Beispiel 7

Spray

Nisin	0,180 g	15
Ethanol pharm. (96%)	497,160 g	
2-Octyldodecanol	2,660 g	20
Parfüm	nach Belieben	
Dimethylether	auf 1 000 000 g	

Beispiel 8

Spray

Epidermin	0,150 g	30
Ethanol pharm. (96%)	497,160 g	
2-Octyldodecanol	2,660 g	
Parfüm	nach Belieben	
Dimethylether	auf 1 000 000 g	35

Beispiel 9

Nisin	1,2000 g	40
Cetylstearylalkohol	20,000 g	
2-Octyldodecanol	20,000 g	
Kaolin	200,200 g	
Talkum	200,200 g	
Aerosil	48,200 g	45
Parfüm	nach Belieben	
Reisstärke	auf 1 000 000 g	

Beispiel 10

Epidermin	1,000 g	50
Cetylstearylalkohol	20,000 g	
2-Octyldodecanol	20,000 g	
Kaolin	200,200 g	55
Talkum	200,200 g	
Aerosil	48,200 g	
Parfüm	nach Belieben	
Reisstärke	auf 1 000 000 g	60

65

Best Available Copy

Beispiel 11

Waschgelkonzentrat

5	Nisin	9,000 g
	Cocoamidopropylbetain	613,300 g
	Tipa-Laurylethersulfat	306,700 g
	Kochsalz	nach Belieben
	Parfüm, Farbstoff	nach Belieben
10	Citronensäure	1,000 g
	Glycerin	10,000 g
	Wasser	auf 1 000 000 g

Beispiel 12

Waschgelkonzentrat

20	Epidermin	7,000 g
	Cocoamidopropylbetain	613,300 g
	Tipa-Laurylethersulfat	306,700 g
	Kochsalz	nach Belieben
	Parfüm, Farbstoff	nach Belieben
25	Citronensäure	1,000 g
	Glycerin	10,000 g
	Wasser	auf 1 000 000 g

30 Die Zusammensetzungen gemäß den Beispielen 1—12 wurden anhand des sogenannten "Sniff-Tests" beurteilt. Es wurden erfindungsgemäße Zusammensetzungen gegen Placebos, also bis auf den Gehalt an Wirksubstanz identische Zusammensetzungen getestet. Ein Kollektiv von 40 Probanden hatte die Auflage, jeweils eine Achselhöhle mit erfindungsgemäßer Zusammensetzung und die andere mit Placebo zu behandeln. Die Probanden trugen daraufhin drei Stunden lang ein Hemd mit Slipeinlagen unter den Achseln. Nach Ablauf dieser Zeit wurden die Slipeinlagen in separate Flaschen überführt. Der Geruch der Einlagen wurde von drei Prüfpersonen beurteilt. Der Versuch wurde als Doppelblindversuch durchgeführt, so daß weder die Probanden noch die Prüfpersonen wußten, welche Achsel mit welcher Zusammensetzung behandelt worden war.

35 Es stellte sich heraus, daß die wirkstoffhaltigen Zubereitungen in jeweils 38 von 40 Fällen subjektiv besser wirkten als die entsprechenden Placebos. In 2 von 40 Fällen gaben die Prüfpersonen an, behandelte und unbehandelte Proben würden sich nicht voneinander unterscheiden.

Patentansprüche

- 45 1. Kosmetische Desodorantien, gekennzeichnet durch einen wirksamen Gehalt an Lantibiotika, wobei die Lantibiotika sowohl einzeln als auch im Gemisch vorliegen können.
2. Kosmetische Desodorantien nach Anspruch 1, gekennzeichnet dadurch, daß die Lantibiotika gewählt werden aus der Gruppe Nisin, Epidermin, Subtilin, Cinramycin, Duramycin, Ancovenin, Pep 5, Gallidermin.
3. Kosmetische Desodorantien nach Anspruch 1 oder 2, durch einen Gehalt von 0,1—10 000 ppm an Lantibiotika, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierungen, gekennzeichnet.
- 50 4. Kosmetische Desodorantien nach einem der Ansprüche 1—3, durch einen Gehalt von 2—750 ppm an Lantibiotika, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierungen, gekennzeichnet.
5. Kosmetische Desodorantien nach einem der Ansprüche 1—4, durch einen Gehalt von 5—400 ppm an Lantibiotika, bezogen auf das Gesamtgewicht der Formulierung, gekennzeichnet.
6. Kosmetische Desodorantien nach einem der Ansprüche 1—5, dadurch gekennzeichnet, daß sie im sauren Bereich, vorzugsweise in einem Bereich von 2,5—6,5, abgepuffert sind.
7. Kosmetische Desodorantien nach einem der Ansprüche 1—6, dadurch gekennzeichnet, daß sie in einem pH-Bereich von 3,5—4,8 abgepuffert sind.
8. Kosmetische Desodorantien nach einem der Ansprüche 1—7, dadurch gekennzeichnet, daß sie in Form von Deo-Sprays, Roll-ons, Pumpsprays, Tinkturen, Intimreinigungsmittel, Shampoos, Dusch- oder Badezubereitungen, Pudern, Pudersprays oder Deo-Stifte vorliegen.
- 60 9. Verwendung von Zusammensetzungen mit einem wirksamen Gehalt an Lantibiotika nach einem der Ansprüche 1—8 als kosmetische Desodorantien.

65